

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
16. Januar 2003 (16.01.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 03/004023 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **A61K 31/4184**,  
C07D 235/18, 401/04, 409/04, 403/04, 405/04, 413/04,  
403/06, 401/06, 401/14, 403/14, 405/14

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/07597

(22) Internationales Anmeldedatum:  
6. Juli 2002 (06.07.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
101 34 775.8 6. Juli 2001 (06.07.2001) DE

(71) Anmelder: **SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT**  
[DE/DE]; Frau Dr. Kirsch, Corporate Patents, Müllerstr.  
178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder: **BLUME, Thorsten**; Tschaikowskistr. 16,  
16552 Schildow (DE). **HALFBRODT, Wolfgang**;  
Luisenstr. 17A, 13505 Berlin (DE). **KUHNKE, Joachim**;  
Schlegelstr. 2, 14469 Potsdam (DE). **MOENNING,**  
**Ursula**; Eichendamm 5, 15569 Woltersdorf (DE). **EL-**  
**GER, Bernd**; Schwarzspechtweg 49, 13505 Berlin (DE).  
**SCHNEIDER, Herbert**; Salzachstr. 26, 14129 Berlin  
(DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,  
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,  
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,  
MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,  
SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN,  
YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT,  
SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

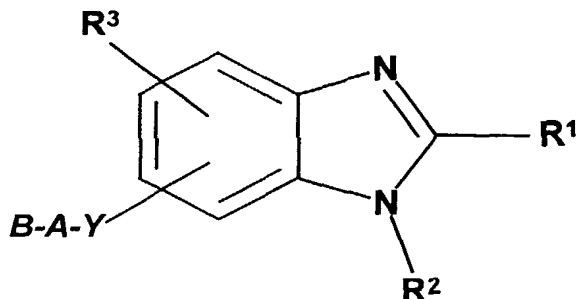
**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden  
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen  
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) **Title:** 1-ALKYL-2-ARYL-BENZIMIDAZOLE DERIVATIVES, THEIR USE FOR PRODUCING MEDICAMENTS AND  
PHARMACEUTICAL PREPARATIONS CONTAINING SAID DERIVATIVES

(54) **Bezeichnung:** 1-ALKYL-2-ARYL-BENZIMIDAZOLDERIVATE, DEREN VERWENDUNG ZUR HERSTELLUNG VON  
ARZNEIMITTELN SOWIE DIESE DERIVATE ENTHALTENDE PHARMAZEUTISCHE PRÄPARATE



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel benzimidazole derivatives of general formula (I), wherein the groups <I>R<sup>1</sup></I>, <I>R<sup>2</sup></I>, <I>R<sup>3</sup></I>, <I>A</I>, <I>B</I> and <I>Y</I> are defined as per the definition and the claims. The invention also relates to the use of these compounds for producing a medicament for the prophylaxis and treatment of diseases linked to the activation of microglia and to pharmaceutical preparations containing said compounds.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung be-  
trifft neuartige Benzimidazolderivate mit der allgemeinen Formel (I), wobei die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, A, B und Y die in der Beschreibung  
und den Ansprüchen angegebenen Bedeutungen haben, die Verwendung dieser Verbindungen zur Herstellung eines Arzneimittels  
zur Behandlung und Prophylaxe von mit Mikroglia-Aktivierung assoziierten Erkrankungen sowie pharmazeutische Präparate, die  
diese Verbindungen enthalten.



WO 03/004023 A1































































































































































































